



①9 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENTAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**  
⑩ **DE 44 19 783 A 1**

⑤ Int. Cl.<sup>6</sup>:  
**A 61 K 7/06**

③③

⑳ Aktenzeichen: P 44 19 783.7  
㉑ Anmeldetag: 6. 6. 94  
㉒ Offenlegungstag: 7. 12. 95

DE 44 19 783 A 1

㉑ Anmelder:  
Asta Medica AG, 01277 Dresden, DE

㉒ Erfinder:  
Weischer, Carl Heinrich, Dr., 53115 Bonn, DE; Ulrich,  
Heinz, Dr., 63843 Niedernberg, DE; Schindler,  
Heward, Dr., 61389 Schmitten, DE

⑤④ Haarkur-Pflege-Shampoo

⑤⑦ Haarkur-Pflege-Shampoo, bestehend aus oxidierte oder reduzierte Enantiomere der  $\alpha$ -Liponsäure, Dihydroliponsäure (Racemat) oder deren Ester, 6,6-Bisnorliponsäure, Tetranorliponsäure oder die 1,2-Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure oder ihre Alkalisalze und ein oder mehrere Kombinationspartner, wie Selenosalze, Dinatriumsalz, Kaliumsalz eines Kondensationsproduktes aus Laurinsäure und Eiweißhydrolysat, Palmkernfettsäure-Sarkosid des Methyltaurins, Palmkernfettsäure-Sarkosid des Triethanolamins, Natriumsalz eines Kondensationsproduktes aus Undecylensäure, wasserlöslichen Vitamin E oder F, Ascorbinsäure, Bierextrakt, Kamillenblütenextrakt oder Farbkonzentraten.

DE 44 19 783 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

BUNDESDRUCKEREI 10. 95 508 049/459

5/30

## DE 44 19 783 A1

## Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Haarkur-Pflege-Shampoo, das sich insbesondere zur Behandlung von Haarausfall, Haarwuchsstörungen, zytostatika induzierte Alopezie, Haarbrüchigkeit, Kopfschuppen bei trockener und ölgiger Seborrhoe, impetiginisierter Ekzeme und Pyodermien der Kopfhaut, seborrhoisches Ekzem des Haarbodens, seborrhoisches Begleitsymptome der androgenetischen Alopezie und zur Verlängerung der Lebensdauer der Haare eignet.

Als Krankheitsbild wird beispielsweise Haarausfall, Haarwuchsstörungen, Seborrhoe, Kopfschuppen oder eine chronische Haarbodenentzündung, Haarbalgentzündung oder eine entzündliche ekzematöse Kopfhautveränderung beobachtet.

Die Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist es, hier Abhilfe zu schaffen und ein Haarkur-Pflege-Shampoo mit synergistischer Wirkung durch Kombination von Wirkstoffen zur Verfügung zu stellen.

Erfindungsgemäß wird das dadurch erreicht, daß man ein Haarkur-Pflege-Shampoo, bestehend aus mindestens den Wirkstoffen:

- a) oxidierte oder reduzierte Enantiomere der  $\alpha$ -Liponsäure, Dihydroliponsäure (Racemat) oder deren Ester, 6,8-Bisnorliponsäure, Tetranorliponsäure oder die 1,2-Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure oder ihre Alkalisalze in einer Konzentration von beispielsweise 0,2 bis 10%, vorzugsweise 0,5 bis 4% und
- b) ein oder mehrere Kombinationspartner, wie Selenalzen, Dinatriumsalz, Kaliumsalz eines Kondensationsproduktes aus Laurinsäure und Eiweißhydrolysaten, Palmkernfettsäure-Sarkosid des Methyltaurins, Palmölkernfettsäure-Sarkosid des Triethanolamins, Natriumsalz eines Kondensationsproduktes aus Undecylensäure, wasserlöslichen Vitamin E oder F, Ascorbinsäure, Bierextrakt, Kamillenblütenextrakt oder Farbkonzentraten einsetzt.

Das Haarkur-Pflegeschampoo kann beispielsweise bestehen aus:

- a) oxidierten oder reduzierten Enantiomeren der  $\alpha$ -Liponsäure, Dihydroliponsäure (Racemat) oder deren Ester, 6,8-Bisnorliponsäure, Tetranorliponsäure oder die 1,2-Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure oder ihren Alkalisalze in einer Konzentration von beispielsweise 0,2 bis 8%, vorzugsweise 0,5 bis 4% und
- b) Natrium-Selenit, wasserlöslichen Vitamin E oder F, KM BRONIDOX L®, Kamillenblütenextrakt, TEXAPON EVR®, TEXAPON N25®, TEXAPON MLS®, TEXAPON N40®, TEXAPON N70®, TEXAPON MG®, EUPERLAN PK 776®, EUPERLAN PK 771®, COMPERLAN KD®, COMPERLAN 100®, COMPERLAN LS®, DEHYTON K®, Kokosfettsäure-diethanolamid, Fettalkoholethersulfat, Na-Lauryl ethersulfat, NUTRILAN J®, LAMERCIN 50-80®, Natriumchlorid, Konservierungsmittel, Parfülmöl, Bierextrakt oder Farbkonzentraten.

Die  $\alpha$ -Liponsäure ist chemisch gesehen 1,2-Dithia-cyclopentan-3-valeriansäure und ist in Form des R-Enantiomers in Pflanzen und Tieren weit verbreitet. Sie wirkt in vielen enzymatischen Reaktionen als Coenzym, stellt einen Wachstumsfaktor für manche Bakterien und Protozoen dar und wird bei der Behandlung von Knollenblätterpilzvergiftungen eingesetzt.

Weiterhin weist das  $\alpha$ -Liponsäure-Racemat antiphlogistische, antinociceptive (analgetische) sowie zytoprotektive, neuroprotektive, antiallergische und antitumor Eigenschaften auf.

Die reinen, optischen Enantiomeren der  $\alpha$ -Liponsäure (R- und S-Form, das heißt R- $\alpha$ -Liponsäure und S- $\alpha$ -Liponsäure) sind im Gegensatz zu dem Racemat wirksamer. Das R-Enantiomer ist vorwiegend antiphlogistisch und das S-Enantiomer antinociceptiv wirksam, wobei die antiphlogistische Wirkung des R-Enantiomer beispielsweise um einen Faktor 10 stärker ist als diejenige des Racemats.

Die antinociceptive (analgetische) Wirkung des S-Enantiomer ist beispielsweise um bis 6 Faktoren stärker als diejenige des Racemats.

Die Enantiomeren der  $\alpha$ -Liponsäure stellen daher im Vergleich zu dem Racemat sehr viel spezifischere und stärkerer wirksame Wirkstoffe dar.

Diese Wirkungen sind in EP-A 901 213 405 beschrieben.

Dieser Synergismus wird vermutet durch den Schutz des Elastins, einem Bestandteil des Bindegewebes der Kopfhaut, durch die erfindungsgemäße Kombination mit der  $\alpha$ -Liponsäure. Durch die beschriebene bekannte antiphlogistische und Kalziumfängereigenschaften der  $\alpha$ -Liponsäure kommt es zur Hemmung der katabolen Enzyme.

Das Haarkur-Pflege-Shampoo kann beispielsweise in Tuben, Flaschen oder verschweißten Kunststoffbeuteln zur äußerlichen Anwendung vorliegen.

## Ausführungsbeispiele

## Beispiel 1

100 g Lösung enthält:

## DE 44 19 783 A1

R-Enantiomer der $\alpha$ -Liponsäure	2,00 g	
Kaliumsalz eines Kondensationsproduktes aus Laurinsäure und Eiweißhydrolysaten	4,95 g	5
Palmkernfettsäuresarkosid des Methyltaurin	1,00 g	
Palmkernfettsäuresarkosid des Triethanolamins	1,00 g	
Natriumsalz eines Kondensationsproduktes aus Undecylensäure und Eiweißhydrolysaten	0,70 g	10
Hilfsstoffe: Farbe, Parfümöl, Konservierungsstoffe		15

## Beispiel 2

100 g Lösung enthält:

R-Enantiomer der $\alpha$ -Liponsäure	2,0 %	
Natrium-Selenit	0,5 %	25
Na-Fettalkoholpolyglykoethersulfat	40,0 %	
Kokosfettsäurediethanolamid	1,8 %	
NaCl	0,9 %	30
NUTRILAN L	5,0 %	
LAMERICIN 50-80	1,0 %	35
Konservierungsmittel		
Farbe,		
Parfümöl,		40
Wasser entmineralisiert	ad 100 %	

## Beispiel 3

100 g Lösung enthält:

R-Enantiomer der $\alpha$ -Liponsäure	2,0 %	
Vitamin E wasserlöslich	2,0 %	50
TEXAPON MLS	40,0 %	
KM BRONODOX L	0,2 %	
NaCl	1,5 %	55
Konservierungsmittel		
Farbe		60
Kamillenblütenextrakt,		
Wasser entmineralisiert	ad 100 %	65

## Beispiel 4

100 g Lösung enthält:

**DE 44 19 783 A1**

	Natirumsalz der 1,2 Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure	0,5 %
	Vitamin F wasserlöslich	2,0 %
5	TEXAPON MLS	40,0 %
	Na-Selenit	0,5 %
	KM BRONIDOX L	0,2 %
10	NaCl	1,5 %
	Konservierungsmittel	
15	Farbe	
	Parfümöl	
	Bierextrakt	
20	Wasser entmineralisiert	ad 100 %

**Beispiel 5**

25 100 g Lösung enthält:

	Bisnorliponsäure	4,5%
30	Vitamin E wasserlöslich	2,0 %
	Vitamin F wasserlöslich	2,0 %
	TEXAMPON MLS	40,0 %
35	KM BRONIDOX I	0,2 %
	NaCl	1,5 %
40	Konservierungsmittel	
	Farbe	
	Kamillenblütenextrakt	
45	Wasser entmineralisiert	ad 100 %

**Beispiel 6**

50 100 g Lösung enthält:

55

60

65

## DE 44 19 783 A1

Tetranorliponsäure	3,5 %	
Vitamin E wasserlöslich	2,0 %	
DEHYTON K	10,0 %	5
TEXAPON N 25	30,0 %	
Euperlan PK 771	5,0 %	
KM BRONDIDOX L	0,2 %	10
NaCl	1,0 %	

15

Konservierungsmittel

Farbe

Kamillenblütenextrakt

20

Wasser entmineralisiert

ad 100 %

Beispiel 7

25

100 g Lösung enthält:

$\alpha$ -Liponsäuremethylester	2,00 g	30
Kaliumsalz eines Kondensationsproduktes aus Laurinsäure und Eiweißhydrolysaten	4,95 g	
Palmkernfettsäuresarkosid des Methyltaurins	1,00 g	35
Palmkernfettsäuresarkosid des Triethanolamins	1,00 g	
Natriumsalz eines Kondensationsproduktes aus Undecylensäure und Eiweißhydrolysaten	0,70 g	40

Konservierungsmittel

Farbe

45

Kamillenblütenextrakt

Wasser entmineralisiert

ad 100 %

50

Patentansprüche

- Haarkur-Pflege-Shampoo bestehend aus mindestens den Wirkstoffen:
  - oxidierte oder reduzierte Enantiomere der  $\alpha$ -Liponsäure, Dihydroliponsäure (Racemat) oder deren Ester, 6,8-Bisnorliponsäure, Tetranorliponsäure oder die 1,2-Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure oder ihre Alkalisalze in einer Konzentration von 0,2 bis 10% und
  - einem oder mehreren Kombinationspartnern wie Seleniselen, Dinatriumsalz, Kaliumsalz eines Kondensationsproduktes aus Laurinsäure und Eiweißhydrolysaten, Palmkernfettsäure-Sarkosid des Methyltaurins, Palmkernfettsäure-Sarkosid des Triethanolamins, Natriumsalz eines Kondensationsproduktes aus Undecylensäure, wasserlöslichen Vitamin E oder F, Ascorbinsäure, Bierextrakt, Kamillenblütenextrakt oder Farbkonzentraten.
- Haarkur-Pflege-Shampoo nach Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, daß es mindestens aus
  - oxidierten oder reduzierten Enantiomeren der  $\alpha$ -Liponsäure, Dihydroliponsäure (Racemat) oder deren Ester, 6,8-Bisnorliponsäure, Tetranorliponsäure oder die 1,2-Dithiacyclopentan-3-butylsulfonsäure oder ihren Alkalisalze in einer Konzentration von 0,2 bis 8% und
  - einem oder mehreren Kombinationspartnern wie Natrium-Selenit, wasserlöslichen Vitamin E oder F, KM BRONIDOX L®, Kamillenblütenextrakt, TEXAPON EVR®, TEXAPON N25®, TEXAPON MLS®, TEXAPON N40®, TEXAPON N70®, TEXAPON MGOR, EUPERLAN PK 776®, EUPERLAN

DE 44. 19 783 A1

PK 771<sup>®</sup>, GOMPERLAN KD, COMPERLAN 100<sup>®</sup>, COMPERLAN LS, DEHYTON K<sup>®</sup>, Kokosfett-säurediethanolamid, Fettalkoholethersulfat, Na-Laurylethersulfat, NUTRILAN I<sup>®</sup>, LAMERCIN 50-80<sup>®</sup>, Natriumchlorid, Konservierungsmittel, Parfümöl, Bierextrakt oder Farbkonzentraten besteht.

3. Haarkur-Pflege-Shampoo nach Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, daß es insbesondere zur Behandlung von Haarausfall, Haarwuchsstörungen, Zytostatika induzierte Alopezie, Haarbrüchigkeit, Kopfschuppen bei trockener und ölgiger Seborrhoe, impetiginisierter Ekzeme und Pyodermien der Kopfhaut, seborrhoisches Ekzem des Haarbodens, seborrhoisches Begleitsymptome der androgenetischen Alopezie und zur Verlängerung der Lebensdauer der Haare verwendet wird.

4. Haarkur-Pflege-Shampoo nach Anspruch 1 dadurch gekennzeichnet, daß die Wirkstoffe in Tuben, Flaschen oder verschweißten Kunststoffbeuteln zur äußerlichen Anwendung vorliegen.